

[J. Chem. Soc Perkin I, 1978, 716]

Pyrimido[1,4]benzothiazines and Pyrimido[1,5]benzothiazepines. Part 3.***Novel Ring-contraction and Ring-opening of Pyrimido[1,5]benzothiazepines.**

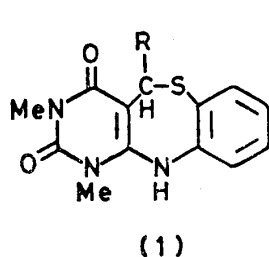
TOKIYUKI HIRAMITSU, YOSHIFUMI MAKI, SHIGEO SENDA

Pyrimido[1,4]benzothiazines and Pyrimido[1,5]benzothiazepines. その3.***Pyrimido[1,5]benzothiazepines の縮環および開裂反応**

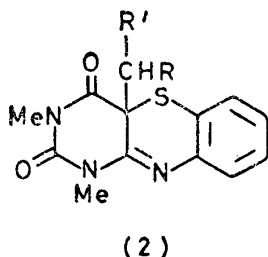
平光時幸, 牧 敬文, 千田重男

Pyrimido[1,5]benzothiazepine (1a) はヨード存在下にアルコールと反応すると 4a-Alkoxymethylpyrimido[1,4]benzothiazines (2aおよび2b) に縮環した。(1a) をヨード存在下にモルフォリンと反応した場合は, メチレン基を失って Pyrimido[1,4]benzothiazine(3) を与える。また(1)はクロロフォルム中 N-halosuccinimides やヨードと反応すると 4a-Halogenoalkylpyrimido[1,4]benzothiazines(2c-f) を生ずる。

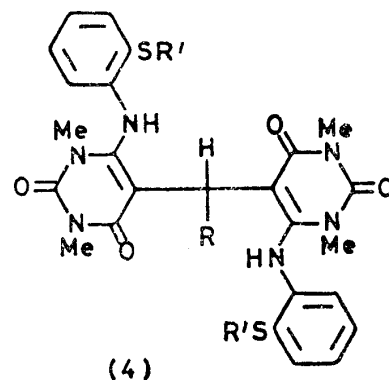
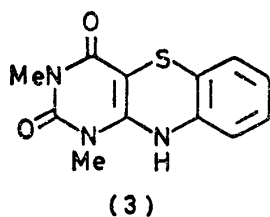
(1a-c)を熱 DMF 中ハロゲン化アルキルと反応すると Bispyrimidylmethane 誘導体(4) が40~60%の収率で得られた。(4)の構造は熱分解反応によって化学的に証明した。以上のごとく Pyrimido[1,5]benzothiazepine (1) は興味ある縮環, 開環反応を起すが, これはエナミン構造と硫黄原子の関与が可能な(1)の特異な構造に帰し得る。



- a; R = H
b; R = Me
c; R = Ph



- a; R = H, R' = OMe
b; R = H, R' = OEt
c; R = H, R' = Br
d; R = H, R' = Cl
e; R = H, R' = I
f; R = Ph, R' = Br



- a; R = H, R' = Me
b; R = H, R' = Et
c; R = H, R' = Bz
d; R = Me, R' = Me
e; R = Ph, R' = Me

* 第2報: Chem. Pharm. Bull. (Tokyo), 25, 292(1977).